

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

PTO 02-1045

French  
Document No. EP 0 714 655 A1

COSMETIC COMPOSITION AND PROCESS FOR COUNTERING  
UNPLEASANT BODY ODORS CAUSED BY PERSPIRATION  
[Composition cosmétique et procédé pour lutter contre les odeurs  
corporelles désagréables produites par la transpiration]

Gérard Holtzinger

UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE  
Washington, D.C. January 2002  
Translated by: Schreiber Translations, Inc.

<u>Country</u>	:	France
<u>Document No.</u>	:	EP 0 714 655 A1
<u>Document Type</u>	:	European Patent Application
<u>Language</u>	:	French
<u>Inventor</u>	:	Gérard Holtzinger
<u>Applicant</u>	:	LABORATOIRE DE BIOLOGIE VEGETALE YVES . ROCHER
<u>IPC</u>	:	A61K 7/32, A61K 7/36
<u>Application Date</u>	:	November 17, 1995
<u>Publication Date</u>	:	June 5, 1996
<u>Foreign Language Title</u>	:	Composition cosmétique et procédé pour lutter contre les odeurs corporelles désagréables produites par la transpiration
<u>English Language Title</u>	:	COSMETIC COMPOSITION AND PROCESS FOR COUNTERING UNPLEASANT BODY ODORS CAUSED BY PERSPIRATION

**Description**

This invention relates to a composition as well as a process for inhibiting the generation of unpleasant body odors emitted during the process of perspiration.

The process of perspiration is due to the sudoriferous glands:

- the exocrine sudoriferous glands that one finds all over the body: their density (140 to 350 per cm<sup>2</sup>) depends on the body region and is adapted to the climate (people living in hot regions have more exocrine glands than those who live in cold regions). These glands are particularly abundant on the forehead, the head, the armpits, the palms and the soles of the feet;
- the apocrine sudoriferous glands are relatively few in number and develop only upon puberty. They can be found only in hairy areas: armpits, genital organs and anus, primarily. These apocrine glands resemble the exocrine glands, but the excretory duct is opened up into a pilo-sebaceous follicle near the skin surface above the outlets of the sebaceous duct.

During its emission, the composition of the sweat varies from a so-called primitive sweat to a final sweat. Sweat is primarily made up of the following:

- . about 99% water,

---

Numbers in the margin indicate pagination in the foreign text.

- . essentially basic aminated acids with the aminated acids being three times as much abundant as the nitrogenated substances, including urea,
- . organic acids (citric, formic, lactic, urocanic),
- . vitamins (B6, B5, H),
- . paraaminobenzoic acid of inositol,
- . mineral salts: Na, K, Ca, Mg, Fe, chlorides, sulfates and phosphates,
- . enzymes that play an important role in the formation of body odors,
- . glycogen and glucose.

Sweating depends primarily on three factors:

- thermal;
- psychic: stress induces sweating located essentially on the forehead, the palms, the armpits, the soles of the feet; this is what is called "cold sweat";
- pharmacological via acetylcholine or adrenaline.

The armpits and the genital areas are an ideal place for bacterial growth and sweat contributes to this by means of the following:

- . a high water content,
- . a satisfactory nutrition level,
- . a favorable temperature.

This explains a high level of bacteria: about  $10^6$  by  $\text{cm}^2$  of skin.

The microorganisms found on the skin of the armpits are representative of the indigenous flora of the skin: 70% of the flora consist of corynebacteria.

Sweat is a mixture of apocrine and exocrine sweat and of sebaceous secretions and at low doses contains steroids. When this mixture reaches a clean skin, it is odorless; but due to the action of certain enzymes of bacterial origin, the steroids are degraded into heavily odor-bearing compounds.

This mechanism was studied especially by C. FROEBE, A. SIMONE, A. CHARIG and E. EIGEN: "Axillary Malodor Production: A New Mechanism," J. Soc. Cosmet. Chem. 41, 173-185 (May-June 1990).

A system was proposed to inhibit the formation of volatile steroids that create an odor by C. CHARIG, C. FROEBE, A. SIMONE and E. EIGEN: "Inhibitor of Odor-Producing Axillary Bacterial Exoenzymes," J. Soc. Cosmet. Chem. 41, 133-145 (May-June 1991).

This article proposes the use of an organic salt of zinc (zinc glycinate) that acts as an inhibitor of  $\beta$ -glucuronidase and of aryl-sulfatase to combat bad odors produced by perspiration.

Generally speaking, cosmetic products used to counter unpleasant odors connected with perspiration act on one or the other of the following three levels:

- on the sudoriferous glands blocking the process of perspiration or acting as regulators of perspiration; /3
- on the degradation of sweat acting as enzymatic or nonenzymatic bactericides;
- on the emission of odors tied to the decomposition of sweat by the bacterial enzymes acting as perfumes or odor absorbers.

This invention proposes an overall system aimed at acting simultaneously at different stages during the process of perspiration in order efficiently to diminish the unpleasant odors generated during the process of perspiration as a whole (after excretion of sweat by the sudoriferous glands until the emission of disagreeable odors tied to the enzymatic processes of sweat degradation).

There are currently no known processes or composition that perform a global action over several stages of the perspiration process.

The only compounds that display a multiple action are the antiperspiration agents that also have a bactericidal action.

This invention thus is intended to remedy the problems of unpleasant odors tied to perspiration, in particular, on the level of the armpits acting simultaneously:

1. on the skin:

- by slightly increasing the skin pH at the level of the perspiration zones.

The pH of sweat is between 4 and 6.8. Thanks to the invention, this pH is raised to 7-8, preferably 7-7.5, in particular, thanks to a buffer system that is well tolerated by the skin.

The elevation to the slightly alkaline pH of the skin pH has the effect of preventing the formation of volatile fatty acids whose emission is one of the main causes of unpleasant odors.

Advantageously, according to the invention, this slight increase in the pH is accomplished thanks to the introduction of substances having a buffer effect already present in the sweat in the natural state, in particular, basic amino acids.

- by diminishing the bioavailability of the water at the level of the perspiration zones, which have the effect of slowing down the development of bacteria, hence limiting the degradation of sweat and promoting the enzymatic inhibition of the above-mentioned enzymes that are behind the degradation of the steroids contained in the sweat;
- additionally, by stabilizing the bacterial development of sweat preferably with the help of compounds present in the sweat in the natural state.

2. by direct inhibition of the enzymes secreted by the bacteria on the skin, especially the corynebacteria:  $\beta$ -glucuronidase and aryl sulfatase.

This inhibition is obtained by using a compound that simultaneously inhibits the action of these two enzymes.



The work done by the inventors enabled them to discover that a powerful inhibitor of these two enzymes was made up of a mineral salt of zinc in an aqueous solution, in particular, zinc sulfate.

3. optionally, by blocking the volatile fatty acids that constitute, together with the volatile steroids, the second group of components of sweat judged to be responsible for unpleasant odors.

This action can be achieved by adding at the level of the perspiration zones some compounds capable of trapping the volatile fatty acids, for example, by making a chemical bond between two chains of short fatty acids.

4. optionally, by adding a properly adapted perfume.

We note two things in the (axillary) perspiration odor:

- pleasant odors: musk, fruit, honey, spice and amber touches;
- unpleasant odors: aminated, acid and fecal touches.

According to the invention, one adds a perfume that can both exalt the agreeable odors and attenuate and even block the disagreeable odors.

The object of the invention thus is a cosmetic composition comprising the following in a vehicle for cosmetic use:

(A) - a compound consisting of an enzymatic inhibitor of  $\beta$ -glucuronidase and aryl sulfatase;

(B) - a compound making it possible to raise the skin pH at the level of the perspiration zones to a slightly basic pH between 7 and 8, preferably between 7 and 7.5;

(C) - a compound that diminishes the bioavailability of water, said compound, in particular, being chosen among the substances present in perspiration in the natural state; and

- a vehicle for cosmetic use.

According to a preferred embodiment, the composition comprises the following: /5

(A) - between 0.02 and 1% of a compound consisting of an enzymatic inhibitor of  $\beta$ -glucuronidase and aryl sulfatase;

(B) - a sufficient quantity of a compound making it possible to raise the skin pH at the level of the perspiration zones to a slightly basic pH, preferably pH 7-7.5;

(C) - between 1 and 10% of a compound that diminishes the bioavailability of water, said compound, in particular, being chosen from among the substances present in perspiration in the natural state; and

- a vehicle for cosmetic use.

Advantageously, the composition also comprises the following:

(D) - a compound suitable for stabilizing the bacterial development of sweat, said compound, in particular, being chosen from among the substances present in sweat in the natural state; and/or

(E) - a compound suitable for trapping the fatty acids with the volatile short chain; and/or

(F) - a perfume system capable of enhancing the pleasant odors of perspiration and inhibiting the unpleasant odors of perspiration.

Advantageously, the composition comprises the following:

- between 0.05 and 0.5% of compound (D) and/or
- between 0.05 and 5% of compound (E); and/or
- between 0.1 and 2% of compound (F).

Advantageously,

- compound (A) is a salt mineral of zinc, preferably zinc sulfate in an aqueous solution;
- compound (B) is a basic amino acid, especially a basic amino acid that in the sweat presents triethanolamine or another buffer such as the buffers sold by SIGMA under the brand names TAPSO® or POPSO®; corresponding respectively to 3-[N-tris-(hydroxymethyl)methylamino]-2-hydroxy-propane sulfonic acid and to piperazine-N,N'-bis(2-hydroxy-propane sulfonic acid) acid;
- compound (C) is preferably sodium lactate;
- compound (D) is preferably paraaminobenzoic acid; this compound reinforces the action of the preceding one;
- compound (E) is preferably a zinc oxide or a magnesium oxide; for aerosol compositions, it is a good idea to replace the zinc or magnesium oxides due to the fact of their insolubility in water, alcohol or in a hydroglycolic environment by a salt of

zinc or magnesium, in particular, an organic salt, for example, zinc ricinoleate.

- the perfume advantageously comprises the following:
  - . a component capable of enhancing the pleasant odors that are naturally present in perspiration,
  - . a component capable of masking the unpleasant odors that are naturally present in perspiration,
  - . possibly a component exercising an antimicrobial activity and an intrinsic activity as a perfume: thymol, vetiverol, for example.

In a preferred manner, one uses the product sold by BUSH, BOAKE and ALLEN under the brand name VEILEX suitable for meeting the first two function requirements mentioned above.

To this end, one must check the compatibility of the perfume, as the case may be, with zinc ricinoleate, which is an odor absorber.

A preferred composition according to the invention comprises the following:

- (A) - between 0.02 and 1% of a zinc mineral salt;
- (B) - a sufficient quantity to stabilize the pH of the composition of a buffer substance chosen especially among triethanolamine, TAPSO® and POPSO®;
- (C) - between 1 and 10% of sodium lactate;
- (D) - between 0.05 and 0.5% of paraaminobenzoic acid;

(E) - between 0.05 and 5% of a compound chosen from among zinc oxide, magnesium oxide and zinc ricinoleate;

(F) - between 0.1 and 2% of a perfume system comprising an active odoriferous agent with an antimicrobial activity chosen from among thymol or vetiverol and/or VEILEX®;

(G) - a vehicle for cosmetic use. /6

The excipient will depend on the presentation of the product:

- aqueous or hydroalcoholic for roll-on conditioning;
- hydroalcoholic for an aerosol vaporizer;
- hydroglycolic (gel) for a stick.

The object of the invention also includes the use of a zinc mineral salt, especially zinc sulfate to inhibit the formation of unpleasant body odors tied to the process of perspiration, possibly together with one or several of ingredients (A) to (F) as defined above.

In the following examples, we will single out the "ACTIVE" portion of the excipient. The quantities are given in terms of weight per 100 parts.

**Example 1:**

Stick deodorant

active	zinc sulfate	0.8
	sodium lactate	3
	paraaminobenzoic acid	0.3
	zinc oxide	2
	perfume	1
	dipropylene glycol	55
	propylene glycol	10
	glycerin	10
	sodium stearate	9
	ethylenediamine tetrasodic salt	0.04
	water as required	100

Remarks: the pH of the formula is slightly basic because of the presence of sodium stearate, which also plays the role of an excipient.

**Example 2:**

Aerosol deodorant

active	zinc sulfate	1
	TEA as required pH 7.5	
	sodium lactate	2
	paraaminobenzoic acid	0.2
	zinc ricinoleate	3
	perfume	1.5
	96% alcohol	80
	water as required	100
	propellant gas: compressed air, pressure:	10 Pa
	1.05	

**Example 3:**

Roll-on deodorant

/1

active	zinc sulfate	0.5
	TEA as required pH 7.5	
	sodium lactate	2
	paraaminobenzoic acid	0.3
	magnesium oxide	3
	perfume	0.4
	hydrogenated ricin 400 E	0.4
	96% alcohol	30
	propylene glycol	5
	glycerin	2
	hydroxyethyl cellulose	0.4
	water as required	100

**Claims**

1. Cosmetic composition comprising:

(A) - a compound consisting of an enzymatic inhibitor of  $\beta$ -glucuronidase and aryl sulfatase;

(B) - a compound making it possible to raise the skin pH at the level of the perspiration zones to a pH of between 7 and 8, preferably between 7 and 7.5;



(C) - a compound that diminishes the bioavailability of water, said compound, in particular, being chosen from among the substances present in perspiration in the natural state; and  
.  
a vehicle for cosmetic use.

2. Composition according to Claim 1, characterized in that it comprises:

(A) - between 0.02 and 1% of a compound consisting of an enzymatic inhibitor of  $\beta$ -glucuronidase and aryl sulfatase;

(B) - a sufficient quantity of a compound making it possible to raise the skin pH at the level of the perspiration zones to a pH between 7 and 8, preferably between 7 and 7.5;

(C) - between 1 and 10% of a compound that diminishes the bioavailability of water, said compound, in particular, being chosen from among the substances present in perspiration in the natural state; and

.  
a vehicle for cosmetic use.

3. Cosmetic composition according to Claim 1, comprising furthermore:

(D) - a compound suitable for stabilizing the bacterial development of sweat, said compound, in particular, being chosen from among the substances present in sweat in the natural state.

4. Composition according to Claim 3, characterized in that it comprises:

(D) - between 0.05 and 5% of a compound capable of stabilizing the bacterial development of sweat, said compound, in particular, being chosen from among the substances present in sweat in the natural state.

5. Cosmetic compound according to Claim 1, comprising furthermore:

(E) - a compound suitable for trapping the fatty acids with the volatile short chain.

6. Cosmetic compound according to Claim 5, characterized in that it comprises:

(E) - between 0.05 and 5% of a compound suitable for trapping the short volatile chain fatty acids.

7. Cosmetic compound according to Claim 1, comprising furthermore:

(F) - a perfume suitable for enhancing the present odors of perspiration and inhibiting the unpleasant odors of perspiration. /8

8. Composition according to Claim 7, characterized in that it comprises:

(F) - between 0.1 and 2% of a perfume suitable for enhancing the pleasant odors of perspiration and inhibiting the unpleasant odors of perspiration.

9. Composition according to Claim 1, characterized in that compound (A) is a zinc mineral salt, in particular, zinc sulfate.

10. Composition according to Claim 1, characterized in that compound (C) is sodium lactate.
11. Composition according to any of Claims 3 to 10, characterized in that compound (D) is paraaminobenzoic acid.
12. Composition according to any of Claims 5 to 11, characterized in that compound (E) is an oxide or an organic salt of zinc or magnesium.
13. Composition according to any of Claims 7 to 12, characterized in that compound (F) is a perfume system comprising at least one component capable of enhancing the pleasant odors of perspiration and at least one component able to inhibit the unpleasant odors of perspiration.
14. Composition according to Claim 1, comprising:
  - (A) - between 0.02 and 1% of a zinc mineral salt;
  - (B) - a sufficient quantity to stabilize the pH of the composition of a buffer substance chosen especially among triethanolamine, TAPSO® and POPSO®;
  - (C) - between 1 and 10% of sodium lactate;
  - (D) - between 0.05 and 0.5% of paraaminobenzoic acid;
  - (E) - between 0.05 and 5% of a compound chosen from among zinc oxide, magnesium oxide and zinc ricinoleate;
  - (F) - between 0.1 and 2% of a perfume system comprising an active odoriferous agent with an antimicrobial activity chosen from among thymol or vetiverol and/or VEILEX®; and

(G) - a vehicle for cosmetic use.

15. Composition according to any of the preceding claims, characterized in that it comes in the form of a solid stick, an aerosol or a gel.

16. Process for inhibiting the formation of unpleasant body odors due to the presence of perspiration consisting of the application on the skin in the place of zones of perspiration emission:

(A) - a compound consisting of an enzymatic inhibitor of  $\beta$ -glucuronidase and aryl sulfatase;

(B) - a compound making it possible to raise the skin pH at the level of the perspiration zones to a pH between 7 and 8, preferably between 7 and 7.5;

(C) - a compound that diminishes the bioavailability of water, said compound, in particular, being chosen among the substances present in perspiration in the natural state.

17. Process according to Claim 16, characterized in that it comprises furthermore the application:

(D) - a compound suitable for stabilizing the bacterial development of sweat, said compound, in particular, being chosen from among the substances present in sweat in the natural state.

18. Process according to Claim 16, characterized in that it comprises furthermore the application:

(E) - a compound suitable for trapping the fatty acids with the volatile short chain.

19. Process according to any of Claims 16 to 18, characterized in that it furthermore comprises the application:

(F) - a perfume suitable for enhancing the present odors of perspiration and inhibiting the unpleasant odors of perspiration.

/9

20. Use of a zinc mineral salt to inhibit the formation of unpleasant body odors tied to the process of perspiration.
21. Use according to Claim 20, characterized in that the zinc mineral salt is zinc sulfate.
22. Use according to Claim 20 or Claim 21, characterized in that the zinc mineral salt is used together with one or several of ingredients (A) to (F) as defined in Claims 1 to 8.

(19)



Europäisches Patentamt

European Patent Office

Office européen des brevets



(11)

**EP 0 714 655 A1**

(12)

**DEMANDE DE BREVET EUROPEEN**

(43) Date de publication:

**05.06.1996 Bulletin 1996/23**

(51) Int Cl.<sup>6</sup> **A61K 7/32, A61K 7/36**

(21) Numéro de dépôt: **95402597.9**

(22) Date de dépôt: **17.11.1995**

(84) Etats contractants désignés:

**AT BE CH DE DK ES FR GB GR IE IT LI LU NL PT SE**

(30) Priorité: **18.11.1994 FR 9413856**

(71) Demandeur: **LABORATOIRE DE BIOLOGIE  
VEGETALE YVES ROCHER  
F-56201 La Gacilly (FR)**

(72) Inventeur: **Holtzinger, Gérard  
F-93200 Saint-Denis (FR)**

(74) Mandataire: **Le Guen, Gérard et al  
CABINET LAVOIX  
2, place d'Estienne d'Orves  
75441 Paris Cédex 09 (FR)**

(54) **Composition cosmétique et procédé pour lutter contre les odeurs corporelles désagréables produites par la transpiration**

(57) L'invention a pour objet un procédé pour lutter contre les odeurs corporelles désagréables émises au cours du processus de transpiration ainsi qu'une composition cosmétique comprenant :

(A) - un composé consistant en un inhibiteur enzymatique de la  $\beta$ -glucuronidase et de l'arylsulfatase;

(B) - un composé permettant d'élever le pH cutané au niveau de zones de transpiration à pH compris entre 7 et 8, de préférence entre 7 et 7,5;

(C) - un composé diminuant la biodisponibilité d l'eau, ledit composé étant notamment choisi parmi les substances présentes dans la transpiration à l'état naturel; et

- un véhicule à usage cosmétique.

**EP 0 714 655 A1**

## Description

La présente invention concerne une composition ainsi qu'un procédé pour inhiber la formation d'odeurs corporelles désagréables émises pendant le processus de transpiration.

Le processus de transpiration est dû aux glandes sudoripares :

- les glandes sudoripares eccrines que l'on trouve sur l'ensemble du corps : leur densité (140 à 350 par  $\text{cm}^2$ ) dépend de la région corporelle et est adaptée au climat (les populations des régions chaudes ont plus de glandes eccrines que celles des régions froides). Ces glandes sont particulièrement abondantes sur le front, la tête, les aisselles, les paumes et les plantes de pieds;
- les glandes sudoripares apocrines sont relativement peu nombreuses et ne se développent qu'à la puberté. On ne les trouve que dans les zones poilues : aisselles, organes génitaux et anus principalement. Ces glandes apocrines ressemblent aux eccrines, mais le canal excréteur s'ouvre dans un follicule pilo-sébacé près de la surface cutanée au-dessus de l'abouchement du canal sébacé.

Au cours de son émission, la composition de la sueur varie en passant d'une sueur dite primitive à la sueur définitive. La sueur est composée principalement :

- d'eau à environ 99%
- d'acides aminés basiques essentiellement, les acides aminés acides étant trois fois moins abondants
- des substances azotées dont l'urée
- des acides organiques (citrique, formique, lactique, urocanique)
- des vitamines (B6, B5, H)
- de l'acide paraaminobenzoïque, de l'inositol
- des sels minéraux : Na, K, Ca, Mg, Fe, chlorures, sulfates et phosphates
- des enzymes qui jouent un rôle important dans la formation des odeurs corporelles
- du glycogène et du glucose.

La sudation dépend principalement de 3 facteurs :

- thermique;
- psychique : un stress induit une sudation essentiellement localisée au front, paumes, aisselles, plantes de pieds; c'est la "sueur froide";
- pharmacologique par l'acétylcholine ou l'adrénaline.

Les aisselles et les zones génitales sont un lieu idéal pour la croissance bactérienne et la sueur y contribue de par :

- une teneur en eau élevée,
- un niveau nutritif satisfaisant,
- une température favorable.

Ceci explique un niveau élevé de bactéries : environ  $10^6$  par  $\text{cm}^2$  de peau.

Les microorganismes trouvés sur la peau des aisselles sont représentatifs de la flore indigène de la peau : 70% de la flore est représentée par les corynébactéries.

La sueur est un mélange de sueurs apocrine et eccrine et de sécrétions sébacées et contient, à faible dose, des stéroïdes. Lorsque ce mélange arrive sur une peau propre, il est inodore, mais sous l'action de certaines enzymes d'origine bactérienne, les stéroïdes vont être dégradés en composés fortement odorants.

Ce mécanisme a été particulièrement étudié par : C. FROEBE, A. SIMONE, A. CHARIG et E. EIGEN : Axillary malodor production : a new mechanism - J. Soc. Cosmet. Chem. 41, 173-185 (May - June 1990).

Un système a été proposé pour inhiber la formation de stéroïdes volatils, odorants par : C. CHARIG, C. FROEBE, A. SIMONE et E. EIGEN : Inhibitor of odor-producing axillary bacterial exoenzymes J. Soc. Cosmet. Chem. 41, 133-145 (May - June 1991).

Cet article propose l'utilisation d'un sel organique de zinc (le glycinate de zinc) agissant comme inhibiteur de la  $\beta$ -glucuronidase et de l'aryl-sulfatase pour combattre les mauvaises odeurs produites par la transpiration.

De manière générale, les produits cosmétiques utilisés pour combattre les odeurs désagréables liés à la transpiration agissent à l'un ou l'autre des trois niveaux suivants :

- sur les glandes sudoripares en bloquant le processus de transpiration ou en agissant comme régulateurs de la

transpiration;

- sur la dégradation de la sueur en agissant comme bactéricides enzymatiques ou non enzymatiques;
- sur l'émission d'odeurs liées à la décomposition de la sueur par les enzymes bactériennes en agissant, comme parfums ou absorbeurs d'odeurs.

La présente invention propose un système global visant à agir simultanément à différents stades du processus de transpiration afin de diminuer de façon efficace les odeurs désagréables générées au cours du processus de transpiration dans sa totalité (depuis l'excrétion de la sueur par les glandes sudoripares jusqu'à l'émission d'odeurs désagréables liée aux processus enzymatiques de dégradation de la sueur).

A ce jour aucun procédé, ni aucune composition ayant une action globale sur plusieurs stades du processus de transpiration ne sont connus.

Les seuls composés ayant une action multiple sont les agents antitranspirants qui possèdent également une action bactéricide.

La présente invention se propose donc de remédier aux problèmes des odeurs désagréables liées à la transpiration notamment au niveau des aisselles en agissant à la fois :

1.- sur la peau :

- en augmentant légèrement le pH cutané au niveau des zones de transpiration.

Le pH de la sueur est compris entre 4 et 6,8. Grâce à l'invention on élève ce pH à 7-8, de préférence 7-7,5 notamment grâce à un système tampon bien toléré par la peau.

L'élévation à pH légèrement alcalin du pH cutané a pour effet de prévenir la formation des acides gras volatils dont l'émission est l'une des causes principales des odeurs désagréables.

Avantageusement selon l'invention, cette augmentation légère du pH est réalisée grâce à l'apport de substances ayant un effet tampon déjà présentes dans la sueur à l'état naturel, en particulier des aminoacides basiques.

- en diminuant la biodisponibilité de l'eau au niveau des zones de transpiration, ce qui a pour effet de freiner le développement des bactéries donc de limiter la dégradation de la sueur et de favoriser l'inhibition enzymatique des enzymes précitées à l'origine de la dégradation des stéroïdes contenus dans la sueur;
- de façon facultative en stabilisant le développement bactérien de la sueur, de préférence à l'aide de composés présents dans la sueur à l'état naturel.

2. - par inhibition directe des enzymes secrétées par les bactéries de la peau, notamment les corynebactéries : le  $\beta$ -glucuronidase et l'aryl sulfatase.

Cette inhibition est obtenue en utilisant un composé inhibant simultanément l'action de ces deux enzymes.

Les travaux des inventeurs les ont amenés à découvrir qu'un inhibiteur puissant de ces deux enzymes était constitué par un sel minéral de zinc, en solution aqueuse, notamment le sulfate de zinc.

3. - de manière facultative par blocage des acides gras volatils qui constituent avec les stéroïdes volatils le second groupe de composants de la sueur jugé responsable des odeurs désagréables.

Cette action peut être obtenue en ajoutant au niveau des zones de transpiration des composés aptes à piéger les acides gras volatils, par exemple en réalisant une liaison chimique entre deux chaînes d'acides gras courtes.

4. - de manière facultative par addition d'un parfum adapté.

Dans l'odeur de transpiration (axillaire), on note deux choses :

- des odeurs agréables : notes musquée, fruitée, mielleuse, épicée et ambrée;
- des odeurs désagréables : notes aminée, aigre et fécale.

Selon l'invention, on ajoute un parfum capable à la fois d'exalter les odeurs agréables et atténuer, voire bloquer les odeurs désagréables.

L'invention a ainsi pour objet une composition cosmétique comprenant dans un véhicule à usage cosmétique :

(A) - un composé consistant en un inhibiteur enzymatique de la  $\beta$ -glucuronidase et de l'arylsulfatase;

(B) - un composé permettant d'élever le pH cutané au niveau des zones de transpiration à pH légèrement basique compris entre 7 et 8, de préférence entre 7 et 7,5;

(C) - un composé diminuant la biodisponibilité de l'eau, ledit composé étant notamment choisi parmi les substances présentes dans la transpiration à l'état naturel ; et

- un véhicule à usage cosmétique.



## EP 0 714 655 A1

Selon un mode de réalisation préféré, la composition comprend :

(A) - de 0,02 à 1 % d'un composé consistant en un inhibiteur enzymatique de la  $\beta$ -glucuronidase et de l'arylsulfatase;  
(B) - une quantité suffisante d'un composé permettant d'élever le pH cutané au niveau des zones de transpiration à pH légèrement basique, de préférence pH 7-7,5;

(C) - de 1 à 10 % d'un composé diminuant la biodisponibilité de l'eau, ledit composé étant notamment choisi parmi les substances présentes dans la transpiration à l'état naturel; et

- un véhicule à usage cosmétique.

Avantageusement, la composition comprend en outre :

(D) - un composé apte à stabiliser le développement bactérien de la sueur, ledit composé étant notamment choisi parmi les substances présentes dans la sueur à l'état naturel; et/ou

(E) - un composé apte à piéger les acides gras à chaîne courte volatils; et/ou

(F) - un système parfum apte à exalter les odeurs agréables de la transpiration et à inhiber les odeurs désagréables de la transpiration.

Avantageusement, la composition comprend :

- de 0,05 à 0,5 % du composé (D) ; et/ou
- de 0,05 à 5 % du composé (E) ; et/ou
- de 0,1 à 2 % du composé (F).

Avantageusement,

- le composé (A) est un sel minéral de zinc, de préférence le sulfate de zinc en solution aqueuse;
- le composé (B) est un aminoacide basique notamment un aminoacide basique présent dans la sueur, la triéthanolamine ou un autre tampon tels les tampons commercialisés par SIGMA sous les dénominations TAPSO<sup>R</sup> ou POPSO<sup>R</sup>; correspondant respectivement à l'acide 3-[N-tris-(hydroxyméthyl)méthylamino]-2-hydroxy-propane sulfonique et à l'acide pipérazine-N,N'-bis (2-hydroxy-propane sulfonique);
- le composé (C) est de préférence le lactate de sodium;
- le composé (D) est de préférence l'acide paraaminobenzoïque; ce composé renforce l'action du précédent;
- le composé (E) est de préférence un oxyde de zinc ou de magnésium; pour les compositions aérosols, il conviendra de remplacer les oxydes de zinc ou de magnésium du fait de leur insolubilité dans l'eau, l'alcool ou en milieu hydroglycolique par un sel de zinc ou de magnésium, notamment un sel organique, par exemple le ricinoléate de zinc.
- le parfum comprend avantageusement :
  - un composant capable d'exalter les odeurs agréables naturellement présentes dans la transpiration,
  - un composant capable de masquer les odeurs désagréables naturellement présentes dans la transpiration;
  - éventuellement un composant ayant une activité antimicrobienne et une activité intrinsèque de parfum : thymol, vétiverol par exemple.

On utilise de façon préférée le produit commercialisé par la société BUSH, BOAKE et ALLEN sous la dénomination VEILEX apte à remplir les deux premières fonctions ci-dessus mentionnées.

A cet effet, il conviendra de vérifier la compatibilité du parfum, le cas échéant, avec le ricinoléate de zinc qui est un absorbeur d'odeurs.

Une composition préférée selon l'invention comprend :

(A) - de 0,02 à 1% d'un sel minéral de zinc.

(B) - une quantité suffisante pour stabiliser le pH de la composition d'une substance tampon choisie notamment parmi la triéthanolamine, le TAPSO<sup>R</sup> et le POPSO<sup>R</sup>;

(C) - de 1 à 10% de lactate de sodium;

(D) - de 0,05 à 0,5% d'acide paraaminobenzoïque;

(E) - de 0,05 à 5% d'un composé choisi parmi l'oxyde de zinc, l'oxyde de magnésium et le ricinoléate de zinc

(F) - de 0,1 à 2% d'un système parfum comprenant un agent actif odorifère à activité antimicrobienne, choisi parmi le thymol ou le vétiverol, et du VEILEX<sup>R</sup>;

(G) - un véhicule à usage cosmétique.

L'excipient dépendra de la présentation du produit :

- 5 . aqueux ou hydroalcoolique pour un conditionnement à bille (roll-on)
- . hydroalcoolique pour un vaporisateur aérosol
- . hydroglycolique (gel) pour un bâton (stick).

10 L'invention a également pour objet l'utilisation d'un sel minéral de zinc, notamment le sulfate de zinc pour inhiber la formation d'odeurs corporelles désagréables liées au processus de transpiration, éventuellement conjointement à un ou plusieurs des ingrédients (A) à (F) tels que définis précédemment.

Dans les exemples qui suivent on distingue la partie "ACTIF" de l'excipient. Les quantités sont données en poids pour 100 parties.

#### 15 Exemple 1 :

Stick déodorant

20		(sulfate de zinc	0,8
		(lactate de sodium	3
	actif	(acide paraaminobenzoïque	0,3
		(oxyde de zinc	2
25		(parfum	1
		dipropylène glycol	55
		propylène glycol	10
		glycérine	10
		stéarate de sodium	9
30		sel tétrasodique de l'éthylènediamine	0,04
		eau qsp	100

Remarque : le pH de la formule est légèrement basique en raison de la présence du stéarate de sodium qui joue également le rôle d'excipient.

35

#### Exemple 2 :

Déodorant en aérosol

40

		(sulfate de zinc	1
		(TEA qsp pH 7,5	
	actif	(lactate de sodium	2
45		(acide paraaminobenzoïque	0,2
		(ricinoléate de zinc	3
		(parfum	1,5
		alcool à 96°	80
		eau qsp	100
50		gaz propulseur : air comprimé, pression: 1.05	10 Pa

#### Exemple 3 :

55 Déodorant à bille

actif	(sulfate de zinc	0,5
	(TEA qsp pH 7,5	
	(lactate de sodium	2
	(acide paraaminobenzoïque	0,3
	(oxyde de magnésium	3
	(parfum	0,4
	ricin hydrogéné 400E	0,4
	alcool à 96°	30
	propylène glycol	5
	glycérine	2
	hydroxyéthyl-cellulose	0,4
	eau qsp	100

## Revendications

### 1. Composition cosmétique comprenant :

- (A) - un composé consistant en un inhibiteur enzymatique de la  $\beta$ -glucuronidase et de l'arylsulfatase;
- (B) - un composé permettant d'élever le pH cutané au niveau de zones de transpiration à pH compris entre 7 et 8, de préférence entre 7 et 7,5;
- (C) - un composé diminuant la biodisponibilité de l'eau, ledit composé étant notamment choisi parmi les substances présentes dans la transpiration à l'état naturel; et
- un véhicule à usage cosmétique.

### 2. Composition selon la revendication 1, caractérisée en ce qu'elle comprend :

- (A) - de 0,02 à 1 % d'un composé consistant en un inhibiteur enzymatique de la  $\beta$ -glucuronidase et de l'arylsulfatase;
- (B) - une quantité suffisante d'un composé permettant d'élever le pH cutané au niveau des zones de transpiration à pH compris entre 7 et 8, de préférence entre 7 et 7,5;
- (C) - de 1 à 10 % d'un composé diminuant la biodisponibilité de l'eau, ledit composé étant notamment choisi parmi les substances présentes dans la transpiration à l'état naturel, et
- un véhicule à usage cosmétique.

### 3. Composition cosmétique selon la revendication 1, comprenant en outre :

- (D) - un composé apte à stabiliser le développement bactérien de la sueur, ledit composé étant notamment choisi parmi les substances présentes dans la sueur à l'état naturel.

### 4. Composition selon la revendication 3 caractérisée en ce qu'elle comprend :

- (D) - de 0,05 à 0,5 % d'un composé apte à stabiliser le développement bactérien de la sueur, ledit composé étant notamment choisi parmi les substances présentes dans la sueur à l'état naturel.

### 5. Composition cosmétique selon la revendication 1 comprenant en outre :

- (E) - un composé apte à piéger les acides gras à chaîne courte volatils.

### 6. Composition selon la revendication 5, caractérisée en ce qu'elle comprend :

- (E) - de 0,05 à 5 % d'un composé apte à piéger les acides gras à chaîne courte volatils.

### 7. Composition cosmétique selon la revendication 1 comprenant en outre :

(F) - un parfum apte à exalter les odeurs agréables de la transpiration et à inhiber les odeurs désagréables de la transpiration.

8. Composition selon la revendication 7, caractérisée en ce qu'elle comprend :

(F) - de 0,1 à 2 % d'un parfum apte à exalter les odeurs agréables de la transpiration et à inhiber les odeurs désagréables de la transpiration.

9. Composition selon la revendication 1, caractérisée en ce que le composé (A) est un sel minéral de zinc, notamment de sulfate de zinc.

10. Composition selon la revendication 1, caractérisée en ce que le composé (C) est le lactate de sodium.

11. Composition selon l'une quelconque des revendications 3 à 10, caractérisée en ce que le composé (D) est l'acide paraaminobenzoïque.

12. Composition selon l'une quelconque des revendications 5 à 11, caractérisée en ce que le composé (E) est un oxyde ou un sel organique de zinc ou de magnésium.

13. Composition selon l'une quelconque des revendications 7 à 12, caractérisée en ce que le composé (F) est un système parfum comprenant au moins un composant apte à exalter les odeurs agréables de la transpiration et au moins un composant apte à inhiber les odeurs désagréables de la transpiration.

14. Composition selon la revendication 1, comprenant :

(A) - de 0,02 à 1% d'un sel minéral de zinc;

(B) - une quantité suffisante pour stabiliser le pH de la composition d'une substance tampon choisie notamment parmi la triéthanolamine, le TAPSO<sup>R</sup> et le POPSOR<sup>R</sup>;

(C) - de 1 à 10% de lactate de sodium;

(D) - de 0,05 à 0,5% d'acide paraaminobenzoïque;

(E) - de 0,05 à 5% d'un composé choisi parmi l'oxyde de zinc, l'oxyde de magnésium et le ricinoléate de zinc;

(F) - de 0,1 à 2% d'un système parfum comprenant éventuellement un agent actif odorifère à activité antimicrobienne, choisi parmi le thymol ou le vétiverol, et du VEILEX<sup>R</sup>; et

(G) - un véhicule à usage cosmétique.

15. Composition selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisée en ce qu'elle est sous forme d'un bâton solide, d'un aérosol ou d'un gel.

16. Procédé pour inhiber la formation d'odeurs corporelles désagréables dues au processus de transpiration consistant à appliquer sur la peau à l'emplacement des zones d'émission de transpiration :

(A) - un composé consistant en un inhibiteur enzymatique de la  $\beta$ -glucuronidase et de l'arylsulfatase;

(B) - un composé permettant d'élever le pH cutané au niveau des zones de transpiration à pH compris entre 7 et 8, de préférence entre 7 et 7,5;

(C) - un composé diminuant la biodisponibilité de l'eau, ledit composé étant notamment choisi parmi les substances présentes dans la transpiration à l'état naturel.

17. Procédé selon la revendication 16, caractérisé en ce qu'il comprend en outre l'application :

(D) - d'un composé apte à stabiliser le développement bactérien de la sueur, ledit composé étant notamment choisi parmi les substances présentes dans la sueur à l'état naturel.

18. Procédé selon la revendication 16, caractérisé en ce qu'il comprend en outre l'application :

(E) - d'un composé apte à piéger les acides gras à chaîne courte volatils.

19. Procédé selon l'une quelconque des revendications 16 à 18, caractérisé en ce qu'il comprend en outre l'application :

## EP 0 714 655 A1

(F) - d'un parfum apt à exalter les odeurs agréables de la transpiration et à inhiber les odeurs désagréables de la transpiration.

20. Utilisation d'un sel minéral de zinc, pour inhiber la formation d'odeurs corporelles désagréables liées au processus de transpiration.

21. Utilisation selon la revendication 20, caractérisée en ce que le sel minéral de zinc est le sulfate de zinc.

22. Utilisation selon la revendication 20 ou la revendication 21, caractérisée en ce que le sel minéral de zinc est utilisé conjointement à un ou plusieurs des ingrédients (A) à (F) définis aux revendications 1 à 8.



Office européen  
des brevets

**RAPPORT PARTIEL  
DE RECHERCHE EUROPEENNE**  
qui selon la règle 45 de la Convention sur le brevet  
européen est considéré, aux fins de la procédure ultérieure  
comme le rapport de la recherche européenne

Numero de la demande

EP 95 40 2597

DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS			
Catégorie	Citation du document avec indication, en cas de besoin, des parties pertinentes	Revendication concernée	CLASSEMENT DE LA DEMANDE (Int.Cl.6)
A	FR-A-2 394 290 (UNILEVER PLC) * le document en entier * ---	1,7,14	A61K7/32 A61K7/36
A	LU-A-73 343 (L'OREAL)  * le document en entier * ---	1,7,10, 14	
A	DE-A-33 27 840 (BLENDAX-WERKE R. SCHNEIDER GMBH & CO) * le document en entier * -----	1,7-10, 14	
			DOMAINES TECHNIQUES RECHERCHES (Int.Cl.6)
			A61K
<b>RECHERCHE INCOMPLETE</b>			
<p>La division de la recherche estime que la présente demande de brevet européen n'est pas conforme aux dispositions de la Convention sur le brevet européen au point qu'une recherche significative sur l'état de la technique ne peut être effectuée au regard d'une partie des revendications.</p> <p>Revendications ayant fait l'objet de recherches complètes: Revendications ayant fait l'objet de recherches incomplètes: Revendications n'ayant pas fait l'objet de recherches: Raison pour la limitation de la recherche:</p> <p>voir feuille supplémentaire C</p>			
Lieu de la recherche		Date d'achèvement de la recherche	Examineur
LA HAYE		12 Mars 1996	Couckuyt, P
<p><b>CATEGORIE DES DOCUMENTS CITES</b></p> <p>X : particulièrement pertinent à lui seul Y : particulièrement pertinent en combinaison avec un autre document de la même catégorie A : arrière-plan technologique O : divulgation non-écrite P : document intercalaire</p> <p>T : théorie ou principe à la base de l'invention E : document de brevet antérieur, mais publié à la date de dépôt ou après cette date D : cité dans la demande L : cité pour d'autres raisons &amp; : membre de la même famille, document correspondant</p>			

EPO FORM 150 (01.87) (P4/C6)



EP 95 40 2597

-C-

RECHERCHE INCOMPLETE

Revendications ayant fait l'objet de : 7-15,20,21  
recherches complètes

Revendications ayant fait l'objet de : 1-6,16-19,22  
recherches incomplètes

Raison : Les définitions pour les composés A-D dans cette composition cosmétique ne sont pas des définitions limitées pour caractériser des composés chimiques. La recherche a été faite explicitement pour les exemples des composés A-D mentionnés dans la description et les exemples.